

## 特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)  
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 15 APR 2004

WIPO PCT

出願人又は代理人 の書類記号 PF-030011-WO	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/11615	国際出願日 (日.月.年) 11.09.2003	優先日 (日.月.年) 20.09.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl <sup>1</sup> A61K31/166, 31/18, 31/197, 31/198, 31/22, 31/223, 31/33, 31/357, 31/36, 31/440 6, 31/4409, 31/4425, 31/5355, 31/536, 31/553, A61P11/00, 11/08, 11/14, C07D213/38, 213/42, 213/89, 265/26,		
出願人 (氏名又は名称) 株式会社ツムラ		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。
- ☒ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。  
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)  
この附属書類は、全部で 2 ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
- I ☒ 国際予備審査報告の基礎
- II ☐ 優先権
- III ☐ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV ☐ 発明の単一性の欠如
- V ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI ☐ ある種の引用文献
- VII ☐ 国際出願の不備
- VIII ☐ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 04.12.2003	国際予備審査報告を作成した日 25.03.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 伊藤 幸司	4 C 9450
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

## I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に  
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。  
 PCT規則70.16, 70.17)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書 第 1-152 ページ、 出願時に提出されたもの  
 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの  
 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ、 \_\_\_\_\_ 付の書簡と共に提出されたもの

☒ 請求の範囲 第 1, 2 項、 出願時に提出されたもの  
 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの  
 請求の範囲 第 3 項、 16.03.2004 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図、 出願時に提出されたもの  
 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの  
 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図、 \_\_\_\_\_ 付の書簡と共に提出されたもの

☐ 明細書の配列表の部分 第 \_\_\_\_\_ ページ、 出願時に提出されたもの  
 明細書の配列表の部分 第 \_\_\_\_\_ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの  
 明細書の配列表の部分 第 \_\_\_\_\_ ページ、 \_\_\_\_\_ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である \_\_\_\_\_ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表  
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された書面による配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査（または調査）機関に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった  
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 図面の第 \_\_\_\_\_ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

## V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)

請求の範囲

1-3

有

請求の範囲

無

進歩性(IS)

請求の範囲

1-3

有

請求の範囲

無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲

1-3

有

請求の範囲

無

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: SUPURAN, C. T. et al., PROTEASE INHIBITORS: SYNTHESIS OF L-ALANIN HYDROXAMATE SULFONYLATED DERIVATIVES AS INHIBITORS OF CLOSTRIDIUM HISTOLYTICUM COLLAGENASE,

Journal of Enzyme Inhibition, 2000, Vol.15, No.2, pages 111-128

文献2: SCOZZAFAVA, A. et al., Protease inhibitors - Part 5.

Alkyl/arylsulfonyl- and arylsulfonylureido-/arylureido-glycine hydroxamate inhibitors of Clostridium histolyticum collagenase, European Journal of Medicinal Chemistry, 2000, Vol.35, No.3, pages 299-307

文献3: SCOZZAFAVA, A. et al., Protease Inhibitors. Part 8:

Synthesis of Potent Clostridium histolyticum Collagenase Inhibitors Incorporating Sulfonylated L-Alanine Hydroxamate Moieties, Bioorganic & Medicinal Chemistry, 2000, Vol.8, No.3, pages 637-645

文献4: SUPURAN, C. T. et al., Protease inhibitors. Part 7:

Inhibition of Clostridium histolyticum collagenase with sulfonylated derivatives of L-valine hydroxamate, European Journal of Pharmaceutical Sciences, 2000, Vol.10, No.1, pages 67-76

文献5: EP 1 270 66 A 2 (USV PHARMACEUTICAL CORPORATION) 1984.12.05

## &lt;請求の範囲1-3&gt;

請求の範囲1-3に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性及び進歩性を有する。

特に、式(I)で表される化合物が鎮咳薬として有用であること、及び式(IA)又は式(IB)で表される構造を有する化合物は、最も関連のある先行技術文献であると認められる文献1-5にも開示されていない。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

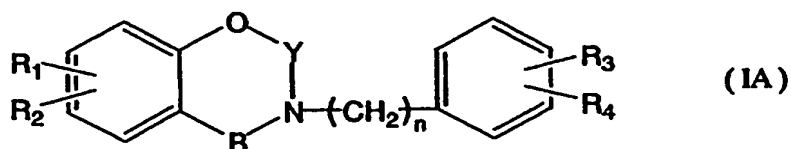
第 欄の続き

国際特許分類 (IPC) の続き

C07D267/14, 291/08, 317/58, 319/18, 413/06, 419/06, 265/22,  
C07C311/29, 311/37, 235/60

## 2. 次式 (I A)

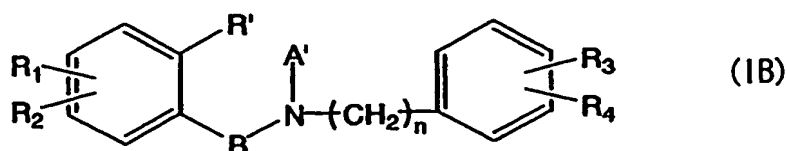
## 【化 2】



(式中、Bは、カルボニル基またはスルホニル基を示し、Yはメチレン基、エチレン基、カルボニル基またはメチレンカルボニル基を示し、 $R_1$ および $R_2$ は、水素原子、アルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、アルキル基、水酸基、アルコシカルボニルアルキルオキシ基、カルボキシアルキルオキシ基を示し、 $R_3$ および $R_4$ は、それぞれ独立して水素原子、アルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、アルキル基、水酸基、アルコシカルボニルアルキルオキシ基、カルボキシアルキルオキシ基、シアノアルキルオキシ基、アミノスルホニル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、アミノカルボニルアルキルオキシ基を示すか、これらが一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、nは1または2の数を意味する)で表される化合物。

## 3. (補正後) 次式 (I B)

## 【化 3】



(式中、A'は、アルコシカルボニルアルキル基、カルボキシアルキル基、ピリジアルキル基、ピリジンオキシドールアルキル基、キノリルアルキル基、インドリ

ルアルキル基、ピロリジルアルキル基、フリルアルキル基、チエニルアルキル基、ピロリルアルキル基、イミダゾリルアルキル基、ピラゾリルアルキル基、チアゾリルアルキル基、アミノカルボニルアルキル基、シアノアルキル基、カルボキシルベンジル基を示し、Bは、カルボニル基またはスルホニル基を示し、R'は、保護されていても良い水酸基を、R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、水素原子、アルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、アルキル基、水酸基、アルコキシカルボニルアルキルオキシ基、カルボキシルアルキルオキシ基を、nは1または2の数を意味し、nが1のときR<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、アルコキシ基、ベンジルオキシ基、アルキル基、水酸基、アルコキシカルボニルアルキルオキシ基、カルボキシルアルキルオキシ基、シアノアルキルオキシ基、アミノスルホニル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、アミノカルボニルアルキルオキシ基を示すか、これらが一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、nが2のときR<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して水素原子、アルコキシ基、ベンジルオキシ基、ハロゲン原子、アルキル基、水酸基、アルコキシカルボニルアルキルオキシ基、カルボキシルアルキルオキシ基、シアノアルキルオキシ基、アミノスルホニル基、ヒドロキシアルキルオキシ基、アミノカルボニルアルキルオキシ基を示すか、これらが一緒になってアルキレンジオキシ基を示す)で表される化合物。